

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
26. Mai 2005 (26.05.2005)

PCT

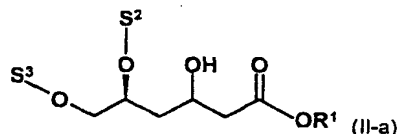
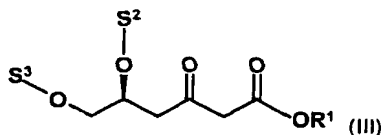
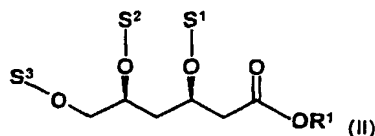
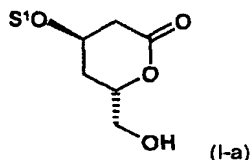
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/047276 A3

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 309/30 (72) Erfinder; und
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012659 (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TARAROV, Vitali
(22) Internationales Anmeldedatum: 9. November 2004 (09.11.2004) [RU/RU]; Chertanovskaya Str. 51-3-275, Moskau (RU).
KÖNIG, Gerd [DE/DE]; Am Fuchsgraben 11 F, 08056
(25) Einreichungssprache: Deutsch Zwickau (DE). BÖRNER, Armin [DE/DE]; Im Winkel
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch 40, 18059 Rostock (DE).
(30) Angaben zur Priorität: 103 52 659.5 11. November 2003 (11.11.2003) DE (74) Anwälte: BEST, Michael usw.; Lederer & Keller, Prinzre-
gentenstr. 16, 80538 München (DE).
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
US): RATIOPHARM GMBH [DE/DE]; Graf-Arco-Str. jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
3, 89079 Ulm (DE). AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF STATINS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON STATINEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of a statin. Said method comprises the following steps: a) a compound of formula (II) is produced, wherein S¹ represents a hydrogen atom or a hydroxyl protective group, S² and S³ independently represent a hydroxyl protective group and R¹ represents a hydrogen atom or a carboxyl protective group. Said compound of formula (II) is produced by stereoselective hydrogenation of a compound of formula (III) in order to form a compound of formula (II-a) and, optionally, by introducing a hydroxyl protective group. b) by lactonising the compound of formula (II) in order to form a compound of formula (I-a).

(57) Zusammenfassung: Erfindungsgemäß wird ein Verfahren zur Herstellung eines Statins zur Verfügung gestellt, umfassend die folgenden Schritte: a) Herstellung einer Verbindung der Formel (II), in der S¹ ein Wasserstoffatom oder eine Hydroxylschutzgruppe bedeutet, S² und S³ unabhängig voneinander Hydroxylschutzgruppen bedeuten und R¹ ein Wasserstoffatom oder eine Carboxylschutzgruppe darstellt. durch stereoselektive Hydrierung einer Verbindung der Formel (III) zu einer Verbindung der Formel (II-a) und gegebenenfalls Einführung einer Hydroxylschutzgruppe und b) Lactonisierung der Verbindung der Formel (II) zu einer Verbindung der Formel (I-a).

WO 2005/047276 A3



MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:

6. Oktober 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.